PCT/EP200 5 / 0 0 0 6 0 8

### **BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND**

PRIORITY

PRIORI



RECEIVED

0 4 FEB 2005

WIPO PCT

# Prioritätsbescheinigung über die Einreichung einer Patentanmeldung

Aktenzeichen:

10 2004 005 786.9

Anmeldetag:

06. Februar 2004

Anmelder/Inhaber:

BAYER CropScience AG, 40789 Monheim/DE

Bezeichnung:

Haloalkylcarboxamide

IPC:

C 07 D, C 07 C, A 01 N

Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlagen dieser Patentanmeldung.

München, den 1. Dezember 2004

Deutsches Patent- und Markenamt

Der Präsident

/Im Auftrag





#### Haloalkylcarboxamide

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Haloalkylcarboxamide, mehrere Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

5

10

15

Es ist bereits bekannt, dass zahlreiche Carboxamide fungizide Eigenschaften besitzen (vgl. z.B. WO 03/010149, WO 02/059086, EP-A 0 824 099, EP-A 0 737 682, EP-A 0 591 699, EP-A 0 589 301, EP-A 0 545 099, DE-A 24 09 011, DE-A 20 06 472, JP-A 2001-302605, JP-A 10-251240, JP-A 8-176112, JP-A 8-92223 und JP-A 53-72823). So sind bereits zahlreiche Alkylcarboxamide bekannt geworden, die im Alkylteil nicht substituiert sind, wie beispielsweise N-Allyl-N-[2-(1,3-dimethylbutyl)phenyl]-1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid aus WO 02/059086, N-[2-(1,3-Dimethylbutyl)phenyl]-2,4-dimethyl-1,3-thiazol-5-carboxamid aus EP-A 0 824 099 und 5-Fluor-1,3-dimethyl-N-[2-(1,3,3-trimethylbutyl)phenyl]-1H-pyrazol-4-carboxamid aus WO 03/010149. Die Wirksamkeit dieser Stoffe ist gut, lässt aber in manchen Fällen, z.B. bei niedrigen Aufwandmengen zu wünschen übrig.

Es wurden nun neue Haloalkylcarboxamide der Formel (I)

in welcher

20 R

für Wasserstoff oder Halogen steht,

R<sup>1</sup> für Wasserstoff oder Methyl steht,

R<sup>2</sup> für Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

R<sup>3</sup> für Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

25 R<sup>4</sup>

für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl; Halogen-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, Halogen-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkoxy)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

30

 $(C_1-C_8-Alkyl)$ carbonyl,  $(C_1-C_8-Alkoxy)$ carbonyl,  $(C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl)$ carbonyl,  $(C_3-C_8-Cycloalkyl)$ carbonyl;  $(C_1-C_6-Halogenalkyl)$ carbonyl,  $(C_1-C_6-Halogenalkoxy)$ carbonyl,  $(Halogen-C_1-C_4-alkoxy-C_1-C_4-alkyl)$ carbonyl,  $(C_3-C_8-Halogencycloalkyl)$ carbonyl mit jeweils

10

15

20

30

1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O) $R^5$ , -CON $R^6R^7$  oder -CH<sub>2</sub>N $R^8R^9$  steht,

R<sup>5</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl; C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR<sup>10</sup> enthalten kann,

 $R^8$  und  $R^9$  unabhängig voneinander für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl;  $C_1$ - $C_8$ -Halogenalkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR<sup>10</sup> enthalten kann,

 $R^{10}$  für Wasserstoff oder  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl steht,

M für einen jeweils einfach durch R<sup>11</sup> substituierten Phenyl-, Pyridin- oder Pyrimidin-, Pyridazin oder Pyrazin-Ring oder für einen durch R<sup>11-A</sup> substituierten Thiazol-Ring steht,

R<sup>11</sup> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, iso-Propyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,

R<sup>11-A</sup> für Wasserstoff, Methyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,

A für den Rest der Formel (A1)

(A1) steht, in welcher

R<sup>12</sup> für Wasserstoff, Cyano, Halogen, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, Aminocarbonyl oder Aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl steht,

 $R^{13}$  für Wasserstoff, Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio steht,

R<sup>14</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Hydroxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cyclo-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, oder Phenyl steht,

- 5 oder
  - A für den Rest der Formel (A2)

(A2) steht, in welcher

 $R^{15}$  und  $R^{16}$  unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

10

15

R<sup>17</sup> für Halogen, Cyano oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>-C

oder

A für den Rest der Formel (A3)

$$R^{19}$$
 (A3) steht, in welcher

R<sup>18</sup> und R<sup>19</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R<sup>20</sup> für Wasserstoff, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

20 A für den Rest der Formel (A4)

R<sup>21</sup> für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

25 oder

A für den Rest der Formel (A5)

$$\mathbb{R}^{23}$$
 (A5) steht, in welcher

R<sup>22</sup> für Halogen, Hydroxy, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5

Halogenatomen steht,

R<sup>23</sup> für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulphinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulphonyl steht,

5 oder

A für den Rest der Formel (A6)

$$R^{25}$$
  $Q^1$   $Q^2$   $Q^2$ 

(A6) steht, in welcher

R<sup>24</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

 $R^{25}$  für  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl steht,

Q<sup>1</sup> für S (Schwefel), O (Sauerstoff) SO, SO<sub>2</sub> oder CH<sub>2</sub> steht,

p für 0, 1 oder 2, wobei R<sup>25</sup> für identische oder verschiedene Reste steht, wenn p für 2 steht,

oder

A für den Rest der Formel (A7)

(A7) steht, in welcher

15

R<sup>26</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A8)

(A8) steht, in welcher

20

25

R<sup>27</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A9)

(A9) steht, in welcher

R<sup>28</sup> und R<sup>29</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen,

 $R^{30}$  für Wasserstoff, Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A10)

(A10) steht, in welcher

R<sup>31</sup> und R<sup>32</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl having 1 bis 5 Halogenatomen stehen,

R<sup>33</sup> für Wasserstoff, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A11)

(A11) steht, in welcher

10

5

R<sup>34</sup> für Wasserstoff, Halogen, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)amino, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R<sup>35</sup> für Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A12)

(A12) steht, in welcher

15

R<sup>36</sup> für Wasserstoff, Halogen, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)amino, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R<sup>37</sup> für Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A13)

(A13) steht, in welcher

20

R<sup>38</sup> für Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht, oder

A für den Rest der Formel (A14)

(A14) steht, in welcher

25

 $R^{39}$  für Wasserstoff oder  $C_i$ - $C_4$ -Alkyl steht,

 $R^{40}$  für Halogen oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A15)

(A15) steht, in welcher

R<sup>41</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

5 oder

A für den Rest der Formel (A16)

(A16) steht, in welcher

 $R^{42}$  für Wasserstoff, Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

10 oder

A für den Rest der Formel (A17)

(A17) steht, in welcher

R<sup>43</sup> für Halogen, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

15

25

oder

A

für den Rest der Formel (A18)

(A18) steht, in welcher

für Wasserstoff, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenato20 men, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Hydroxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl, Di(C<sub>1</sub>C<sub>4</sub>-alkyl)aminosulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenylsulfonyl oder Benzoyl steht,

R<sup>45</sup> für Wasserstoff, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R<sup>46</sup> für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R<sup>47</sup> für Wasserstoff, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A19)

(A19) steht, in welcher

 $R^{48}$  für  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl steht,

gefunden.

5

15

Weiterhin wurde gefunden, dass man Haloalkylcarboxamide der Formel (I) erhält, indem man Weiterhin wurde gefunden, dass man Hexylcarboxamilide der Formel (I) erhält, indem man

10 a) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)

$$A = X^{1}$$
 (II

in welcher

A die oben angegebenen Bedeutungen hat und

X1 für Halogen oder Hydroxy steht,

mit Anilin-Derivaten der Formel (III)

$$\begin{array}{c|c}
 & M \\
 & M \\
 & R^2 \\
 & R^3
\end{array}$$
(III)

in welcher R, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und M die oben angegebenen Bedeutungen haben, gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

20

25

b) Hexylcarboxanilide der Formel (I-a)

$$A \xrightarrow{N} H \xrightarrow{R^2 R} R^3$$
 (I-a)

in welcher R, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, M und A die oben angegebenen Bedeutungen haben mit Halogeniden der Formel (IV)

$$R^{4-A} X^2$$
 (IV)

in welcher

X<sup>2</sup> für Chlor, Brom oder Iod steht,

R<sup>4-A</sup> für  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_4$ alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl genalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; 5 Formyl, Formyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl; Halogen-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, Halogen-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl oxy)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen: nyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl)carbonyl; (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalk-10 oxy)carbonyl, (Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R<sup>5</sup>, -CONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> oder -CH<sub>2</sub>NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup> steht, wobei R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

15

Schließlich wurde gefunden, dass die neuen Haloalkylcarboxamide der Formel (I) sehr gute mikrobizide Eigenschaften besitzen und zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz verwendbar sind.

20 Die erfindungsgemäßen Verbindungen können gegebenenfalls als Mischungen verschiedener möglicher isomerer Formen, insbesondere von Stereoisomeren, wie z. B. E- und Z-, threo- und erythro-, sowie optischen Isomeren, gegebenenfalls aber auch von Tautomeren vorliegen. Es werden sowohl die E- als auch die Z-Isomeren, wie auch die threo- und erythro-, sowie die optischen Isomeren, beliebige Mischungen dieser Isomeren, sowie die möglichen tautomeren Formen beansprucht.

25

Die erfindungsgemäßen Haloalkylcarboxamide sind durch die Formel (I) allgemein definiert. Bevorzugte Restedefinitionen der vorstehenden und nachfolgend genannten Formeln sind im Folgenden angegeben. Diese Definitionen gelten für die Endprodukte der Formel (I) wie für alle Zwischenprodukte gleichermaßen.

- R steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder Brom.
- R steht besonders bevorzugt für Wasserstoff.
- R steht außerdem besonders bevorzugt für Fluor oder Chlor.
- 35  $\mathbb{R}^1$ steht bevorzugt für Wasserstoff.
  - $R^1$ steht außerdem bevorzugt für Methyl.

- R<sup>2</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Methyl, Ethyl oder für jeweils einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl.
- steht <u>besonders bevorzugt</u> für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Fluormethyl, Trichlormethyl, Dichlormethyl, Chlormethyl, Chlorfluormethyl, Fluordichlormethyl, Difluorchlormethyl, Pentafluorethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 1-Chlorbutyl, Heptafluor-n-propyl oder Heptafluorisopropyl.
  - R<sup>2</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl oder Trifluormethyl.
- 10 R<sup>2</sup> steht <u>insbesondere bevorzugt</u> für Methyl.
  - R<sup>2</sup> steht außerdem <u>insbesondere bevorzugt</u> für Ethyl.
  - R<sup>2</sup> steht außerdem <u>insbesondere bevorzugt</u> für Trifluormethyl.
- steht <u>bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Iod oder für jeweils einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl.
- R<sup>3</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl, Difluormethyl, Fluormethyl, Trichlormethyl, Dichlormethyl, Chlormethyl, Chlorfluormethyl, Fluordichlormethyl, Difluorchlormethyl, Pentafluorethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2difluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, 1-Chlorbutyl, Heptafluor-n-propyl oder Heptafluoriso-propyl.
  - R<sup>3</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Chlor oder Trifluormethyl.
  - R<sup>3</sup> steht <u>insbesondere bevorzugt</u> für Chlor.
- 25 R<sup>3</sup> steht außerdem <u>insbesondere bevorzugt</u> für Trifluormethyl.
- steht bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl; C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl; Halogen-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, Halogen-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkoxy)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;
- (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl)carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl)carbonyl; (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl)carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils

1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O) $R^5$ , -CON $R^6R^7$  oder -CH<sub>2</sub>N $R^8R^9$ .

 $R^4$ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, secoder tert-Butyl, Pentyl oder Hexyl, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder iso-Propylsulfinyl, 5 n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder iso-Propylsulfonyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfonyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopentyl, Cyclopentyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethoxymethyl; Formyl, -CH2-CHO, -(CH2)2-CHO, 10 -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,  $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$ , -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,  $-CH_2-CO_2CH(CH_3)_2$ , -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, 15  $-CH_2-CO_2CCl_2CCl_3$ ,  $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CF_3$ ,  $-(CH_2)_2-CO_2CF_2CF_3$ , -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>,-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CCl<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>; Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, iso-Propylcarbonyl, tert-Butylcarbonyl,

> thylcarbonyl, Trifluormethoxycarbonyl, oder  $-C(=O)C(=O)R^5$ ,  $-CONR^6R^7$  oder  $-CH_2NR^8R^9$ . steht <u>ganz besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Methyl, Methoxymethyl, Formyl,  $-CH_2$ -CHO,  $-(CH_2)_2$ -CHO,  $-CH_2$ -CO-CH<sub>3</sub>,  $-CH_2$ -CO-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,  $-CH_2$ -CO-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)CHO,  $-C(=O)C(=O)CH_3$ ,  $-C(=O)C(=O)CH_2OCH_3$ ,  $-C(=O)CO_2CH_3$ ,

> Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyclopropylcarbonyl; Trifluorme-

 $-C(=O)CO_2CH_2CH_3$ .

20

30

 $R^4$ 

25 R<sup>5</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl; C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

R<sup>5</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder iso-Propoxy, tert-Butoxy, Methoxymethyl, Cyclopropyl; Trifluormethyl, Trifluormethoxy.

 $R^6$  und  $R^7$  stehen unabhängig voneinander <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_3$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_3$ -alkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl;  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl, Halogen- $C_1$ - $C_3$ -alkoxy- $C_1$ - $C_3$ -alkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, <u>bevorzugt</u> einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C<sub>1</sub>-

10

15

20

25

30

35

C<sub>4</sub>-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 oder 6 Ringatomen, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR<sup>10</sup> enthalten kann.

- R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> stehen unabhängig voneinander <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, noder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Ethoxymethyl, Ethoxymethyl, Ethoxymethyl, Cyclopentyl, Cyclopentyl, Cyclopentyl, Trifluormethyl, Trifluormethoxymethyl.
- R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, <u>besonders</u>

  <u>bevorzugt</u> einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor,
  Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin,
  Thiomorpholin oder Piperazin, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R<sup>10</sup>
  substituiert sein kann.
- R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> stehen unabhängig voneinander <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl; C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
- R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, <u>bevorzugt</u> einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 oder 6 Ringatomen, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR<sup>10</sup> enthalten kann.
- R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> stehen unabhängig voneinander <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, noder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl; Trifluormethyl, Trifluormethyl, Trifluormethyl, Trifluormethyl,
- R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, <u>besonders</u>

  <u>bevorzugt</u> einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor,
  Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin,
  Thiomorpholin oder Piperazin, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R<sup>10</sup>
  substituiert sein kann.
- R<sup>10</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl.
- R<sup>10</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, secoder tert-Butyl.
- M steht bevorzugt für einen der folgenden Cyclen

wobei die mit "\*" markierte Bindung mit dem Amid, die mit "#" markierte Bindung mit dem Haloalkylrest verknüpft ist.

5 M steht besonders bevorzugt für einen Cyclus ausgewählt aus M-1, M-2, M-3, M-6, M-7 und M-8.

M steht ganz besonders bevorzugt für den Cyclus M-1.

M steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Heterocyclus M-2.

M steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Heterocyclus M-3.

M steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Heterocyclus M-6.

10 M steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Heterocyclus M-7.

M steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Heterocyclus M-8.

R<sup>11</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl oder Trifluormethyl.

R<sup>11</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff oder Chlor.

steht für den Fall, dass M für M-2, M-3, M-4 oder M-5 steht, außerdem <u>bevorzugt</u> für Fluor, wobei Fluor <u>besonders bevorzugt</u> in 6-Position (M-2, M-3) oder in 3-Position (M-4, M-5) steht.

R<sup>11</sup> steht für den Fall, dass M für M-2, M-3, M-4 oder M-5 steht, außerdem <u>bevorzugt</u> für Chlor, wobei Chlor <u>besonders bevorzugt</u> in 6-Position (M-2, M-3) oder in 3-Position (M-4, M-5) steht.

R<sup>11</sup> steht für den Fall, dass M für M-2, M-3, M-4 oder M-5 steht, außerdem <u>bevorzugt</u> für Methyl, wobei Methyl <u>besonders bevorzugt</u> in 4-Position (M-2) oder in 3-Position (M-3, M-4, M-5) steht.

R<sup>11</sup> steht für den Fall, dass M für M-6 steht, außerdem <u>bevorzugt</u> für Methyl, wobei Methyl
25 <u>besonders bevorzugt</u> in 3-Position steht.

R<sup>11</sup> steht für den Fall, dass M für M-6 steht, außerdem <u>bevorzugt</u> für Trifluormethyl, wobei Trifluormethyl <u>besonders bevorzugt</u> in 3-Position steht.

R<sup>11</sup> steht für den Fall, dass M für M-9 steht, außerdem <u>bevorzugt</u> für Methyl, wobei Methyl <u>besonders bevorzugt</u> in 4-Position steht.

10

15

20

25

- 13 - $R^{11}$ steht für den Fall, dass M für M-9 steht, außerdem bevorzugt für Trifluormethyl, wobei Trifluormethyl besonders bevorzugt in 4-Position steht.  $R^{11}$ steht für den Fall, dass M für M-10 steht, außerdem bevorzugt für Methyl, wobei Methyl besonders bevorzugt in 3-Position steht.  $R^{11}$ steht für den Fall, dass M für M-10 steht, außerdem bevorzugt für Trifluormethyl, wobei Trifluormethyl besonders bevorzugt in 3-Position steht.  $R^{11}$ steht für den Fall, dass M für M-11 steht, außerdem bevorzugt für Methyl, wobei Methyl besonders bevorzugt in 3-Position steht.  $R^{11}$ steht für den Fall, dass M für M-11 steht, außerdem bevorzugt für Trifluormethyl, wobei Trifluormethyl besonders bevorzugt in 3-Position steht. R11-A steht bevorzugt für Wasserstoff. R11-A steht außerdem bevorzugt für Methyl. R11-A steht außerdem bevorzugt für Trifluormethyl. Α steht bevorzugt für einen der Reste A1, A2, A3, A4, A5, A6, A9, A10, A11, A12, A16, A17 oder A18. Α steht besonders bevorzugt für einen der Reste A1, A2, A3, A4, A5, A6, A9, A11, A16, A17, A18. A ganz besonders bevorzugt für den Rest A1. A außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A2. außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A3. A A außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A4. Α außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A5. A außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A6. Α außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A9. A außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A11. A außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A16. Α außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A17. Α außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A18.  $R^{12}$ steht bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, iso-Propyl,
- steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Cyclopropyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, Trifluormethylthio, Difluormethylthio, Aminocarbonyl, Aminocarbonylmethyl oder Aminocarbonylethyl.

- R<sup>12</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Monofluormethyl, Monofluorethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, Dichlormethyl, Cyclopropyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Trichlormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethylthio oder Difluormethylthio.
- 5 R<sup>12</sup> steht <u>ganz besonders bevorzugt</u> Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, iso-Propyl, Monofluormethyl, Monofluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
  - R<sup>12</sup> steht <u>insbesondere bevorzugt</u> für Methyl, Difluormethyl, Trifluormethyl oder 1-Fluorethyl.
- 10 R<sup>13</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio oder Ethylthio.
  - R<sup>13</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod oder Methyl.
  - R<sup>13</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder Methyl.
- steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl oder Phenyl.
  - R<sup>14</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl oder Phenyl.
- 20 R<sup>14</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Trifluormethyl oder Phenyl.
  - $R^{14}$  steht insbesondere bevorzugt für Methyl.

- R<sup>15</sup> und R<sup>16</sup> stehen unabhängig voneinander <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R<sup>15</sup> und R<sup>16</sup> stehen unabhängig voneinander <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- R<sup>15</sup> und R<sup>16</sup> stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl.
- 30 R<sup>15</sup> und R<sup>16</sup> stehen <u>insbesondere bevorzugt</u> jeweils für Wasserstoff.
  - R<sup>17</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- steht <u>besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Trifluormethyl,
  Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy oder Trichlormethoxy.

- R<sup>17</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy.
- R<sup>17</sup> steht <u>insbesondere bevorzugt</u> für Methyl.
- 5 R<sup>18</sup> und R<sup>19</sup> stehen unabhängig voneinander <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
  - R<sup>18</sup> und R<sup>19</sup> stehen unabhängig voneinander <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- 10 R<sup>18</sup> und R<sup>19</sup> stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl.
  - R<sup>18</sup> und R<sup>19</sup> stehen <u>insbesondere bevorzugt</u> jeweils für Wasserstoff.
  - R<sup>20</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 15 R<sup>20</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl oder Trifluormethyl.
  - R<sup>20</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Methyl.
- steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>
  C<sub>2</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5

  Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
  - R<sup>21</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trichlormethoxy, Trifluormethylthio, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio oder Trichlormethylthio.
  - R<sup>21</sup> steht <u>ganz besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Difluormethyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl.
  - R<sup>21</sup> steht <u>insbesondere bevorzugt</u> für Iod, Methyl, Difluormethyl oder Trifluormethyl.
  - R<sup>22</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- steht <u>besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethyl-

thio, Trifluormethylthio, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlormethoxy oder Trichlormethoxy.

R<sup>22</sup> steht <u>ganz besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

5

R<sup>23</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Alkylsulphinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Alkylsulphonyl.

steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluormethoxy, Difluormethoxy, Methylsulphinyl oder Methylsulphonyl.

- R<sup>23</sup> steht <u>ganz besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Tri-chlormethyl, Methylsulphinyl oder Methylsulphonyl.
- R<sup>23</sup> steht <u>insbesondere bevorzugt</u> für Wasserstoff.
- R<sup>24</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 20 R<sup>24</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
  - R<sup>25</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Methyl oder Ethyl.
  - R<sup>25</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Methyl.

25

- Q<sup>1</sup> steht <u>bevorzugt</u> für S (Schwefel), SO<sub>2</sub> oder CH<sub>2</sub>.
- Q<sup>1</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für S (Schwefel) oder CH<sub>2</sub>.
- Q<sup>1</sup> steht <u>ganz besonders bevorzugt</u> für S (Schwefel).
- 30 p steht bevorzugt für 0 oder 1.
  - p steht besonders bevorzugt für 0.
  - R<sup>26</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 35 R<sup>26</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluormethyl, Difluormethyl, methyl oder Trichlormethyl.

10

15

25

30

35

- R<sup>26</sup> steht <u>ganz besonders bevorzugt</u> für Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- R<sup>27</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R<sup>27</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluormethyl, Difluormethyl, methyl oder Trichlormethyl.
- R<sup>27</sup> steht <u>ganz besonders bevorzugt</u> für Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

 $R^{28}$  und  $R^{29}$  stehen unabhängig voneinander <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methyl, Ethyl oder  $C_1$ - $C_2$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

- R<sup>28</sup> und R<sup>29</sup> stehen unabhängig voneinander <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- R<sup>28</sup> und R<sup>29</sup> stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- R<sup>28</sup> und R<sup>29</sup> stehen <u>insbesondere bevorzugt j</u>eweils für Wasserstoff.
- 20 R<sup>30</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
  - R<sup>30</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Trifluor-methyl, Difluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
  - R<sup>30</sup> steht <u>ganz besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
  - R<sup>30</sup> steht <u>insbesondere bevorzugt</u> für Methyl.
  - R<sup>31</sup> und R<sup>32</sup> stehen unabhängig voneinander <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Nitro, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
  - R<sup>31</sup> und R<sup>32</sup> stehen unabhängig voneinander <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
  - R<sup>31</sup> und R<sup>32</sup> stehen unabhängig voneinander <u>ganz besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
    - R<sup>31</sup> und R<sup>32</sup> stehen <u>insbesondere bevorzugt</u> jeweils für Wasserstoff.

- $R^{33}$  steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl oder  $C_1$ - $C_2$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen,
- R<sup>33</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Trifluor-methyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- 5 R<sup>33</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
  - R<sup>33</sup> steht <u>insbesondere bevorzugt</u> für Methyl.
- steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-10 alkyl)amino, Cyano, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
  - R<sup>34</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Cyano, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
  - R<sup>34</sup> steht <u>insbesondere bevorzugt</u> für Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl oder Trifluormethyl.
- 20 R<sup>35</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
  - R<sup>35</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
  - R<sup>35</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
  - R<sup>35</sup> steht <u>insbesondere bevorzugt</u> für Methyl, Trifluormethyl oder Difluormethyl.
  - R<sup>36</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)amino, Cyano, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
  - R<sup>36</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Cyano, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino,

  Dimethylamino, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

- R<sup>36</sup> steht <u>insbesondere bevorzugt</u> für Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl oder Trifluormethyl.
- R<sup>37</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
  - R<sup>37</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
  - R<sup>37</sup> steht <u>ganz besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- 10 R<sup>37</sup> steht <u>insbesondere bevorzugt</u> für Methyl, Trifluormethyl oder Difluormethyl.
  - R<sup>38</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R<sup>38</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl,

  Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
  - R<sup>38</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
  - R<sup>39</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl.
- 20 R<sup>39</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Methyl.
  - R<sup>40</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl,
  - R<sup>40</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor oder Methyl.
- 25 R<sup>41</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
  - R<sup>41</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluormethyl, Difluormethyl, methyl oder Trichlormethyl.
- R<sup>41</sup> steht <u>ganz besonders bevorzugt</u> für Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
  - $R^{41}$  steht <u>insbesondere bevorzugt</u> für Methyl oder Trifluormethyl.
  - R<sup>42</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 35 R<sup>42</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Trifluormethyl.

- R<sup>43</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- steht <u>besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- R<sup>43</sup> steht <u>ganz besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor-und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkyl, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl, Methyl-sulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl.
  - R<sup>44</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Hydroxymethyl oder Hydroxyethyl.
- 15 R<sup>44</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Methyl oder Methoxymethyl.
  - R<sup>45</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
- R<sup>45</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl Trifluormethyl,
   Difluormethyl oder Trichlormethyl.
  - $R^{45}$  steht <u>ganz besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff oder Methyl.
  - R<sup>46</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methyl, Ethyl, iso-Propyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
  - R<sup>46</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
  - R<sup>46</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Difluormethyl oder Trifluormethyl.
- steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
  - R<sup>47</sup> steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl oder Trifluormethyl.
  - R<sup>47</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff.
- 35 R<sup>48</sup> steht <u>bevorzugt</u> für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder iso-Propyl.
  - $R^{48}$  steht <u>besonders bevorzugt</u> Methyl oder Ethyl.

Bevorzugt sind solche Verbindungen der Formel (I), in welcher alle Reste jeweils die oben genannten bevorzugten Bedeutungen haben.

Besonders bevorzugt sind solche Verbindungen der Formel (I), in welcher alle Reste jeweils die oben genannten besonders bevorzugten Bedeutungen haben.

5

Bevorzugt und jeweils als Teilmenge der oben genannten Verbindungen der Formel (I) zu verstehen sind folgende Gruppen von neuen Carboxamiden:

Gruppe 1: Haloalkylcarboxamide der Formel (I-a)

10

in welcher R, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, M und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Gruppe 2: Haloalkylcarboxamide der Formel (I-b)

in welcher R, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4-A</sup>, M und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

15

20

25

R<sup>4-A</sup>

steht bevorzugt für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl; C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl; Halogen-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, Halogen-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkoxy)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

 $(C_1-C_6-Alkyl) carbonyl, \ (C_1-C_4-Alkoxy) carbonyl, \ (C_1-C_3-Alkoxy-C_1-C_3-alkyl) carbonyl, \ (C_3-C_6-Cycloalkyl) carbonyl; \ (C_1-C_4-Halogenalkyl) carbonyl, \ (C_1-C_4-Halogenalkoxy) carbonyl, \ (Halogen-C_1-C_3-alkoxy-C_1-C_3-alkyl) carbonyl, \ (C_3-C_6-Halogencycloalkyl) carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder <math>-C(=O)C(=O)R^5$ ,  $-CONR^6R^7$  oder  $-CH_2NR^8R^9$ .

R<sup>4-A</sup>

steht <u>besonders bevorzugt</u> für Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Pentyl oder Hexyl, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder iso-Propylsulfinyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder iso-Propylsulfonyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfonyl, Methoxymethyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Ethoxymethyl, Cy-

10

15

R<sup>4-A</sup>

clopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethoxymethyl; Formyl, -CH2-CHO, -(CH2)2-CHO, -CH2-CO-CH3, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,-CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,  $-CH_2-CO_2CH(CH_3)_2$ -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>,-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CCl<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CCl<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>; Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, iso-Propylcarbonyl, tert-Butylcarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyclopropylcarbonyl; Trifluormethylcarbonyl, Trifluormethoxycarbonyl, oder -C(=O)C(=O)R<sup>5</sup>, -CONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> oder -CH<sub>2</sub>NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>. steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Methoxymethyl, Formyl, -CH2-CHO, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CHO, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)CHO, -C(=O)C(=O)CH<sub>3</sub>, -C(=O)C(=O)CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, -C(=O)CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -C(=O)CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>.

Gruppe 3: Haloalkylcarboxamide der Formel (I-c)

in welcher R, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>11</sup> und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Bevorzugt sind Haloalkylcarboxamide der Formel (I-c), in welcher R<sup>4</sup> für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Haloalkylcarboxamide der Formel (I-c), in welcher R<sup>11</sup> für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Haloalkylcarboxamide der Formel (I-c), in welcher R<sup>4</sup> und R<sup>11</sup> jeweils für Wasserstoff stehen.

25 Gruppe 4: Haloalkylcarboxamide der Formel (I-d)

$$A \xrightarrow{N} \stackrel{R^{11}}{\underset{R^4}{\bigvee}} \stackrel{N}{\underset{R^2}{\bigvee}} \stackrel{R^2}{\underset{R^3}{\bigvee}}$$
 (I-d)

in welcher R,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^{11}$  und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Bevorzugt sind Haloalkylcarboxamide der Formel (I-d), in welcher R<sup>4</sup> für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Haloalkylcarboxamide der Formel (I-d), in welcher R<sup>11</sup> für Wasserstoff steht.

10

Bevorzugt sind Haloalkylcarboxamide der Formel (I-d), in welcher R<sup>4</sup> und R<sup>11</sup> jeweils für Wasserstoff stehen.

Gruppe 5: Haloalkylcarboxamide der Formel (I-e)

$$A = \begin{bmatrix} R^{11} \\ N \\ R^{4} \\ R^{1} \end{bmatrix}$$

$$R^{2} R$$

$$R^{3}$$
(I-e)

in welcher R,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^{11}$  und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Bevorzugt sind Haloalkylcarboxamide der Formel (I-e), in welcher R<sup>4</sup> für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Haloalkylcarboxamide der Formel (I-e), in welcher R<sup>11</sup> für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Haloalkylcarboxamide der Formel (I-e), in welcher R<sup>4</sup> und R<sup>11</sup> jeweils für Wasserstoff stehen.

Gruppe 6: Haloalkylcarboxamide der Formel (I-f)

in welcher  $R,\,R^1,\,R^2,\,R^3,\,R^4,\,R^{11}$  und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Bevorzugt sind Haloalkylcarboxamide der Formel (I-f), in welcher R<sup>4</sup> für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Haloalkylcarboxamide der Formel (I-f), in welcher R<sup>11</sup> für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Haloalkylcarboxamide der Formel (I-f), in welcher R<sup>4</sup> und R<sup>11</sup> jeweils für Wasserstoff stehen.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I) (und ebenso der Gruppen 1 bis 6), in welcher R<sup>4</sup> für Wasserstoff steht.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I) (und ebenso der Gruppen 1 bis 6), in welcher R<sup>4</sup> für Formyl steht.

Hervorgehoben sind außerdem Verbindungen der Formel (I) (und ebenso der Gruppen 1 bis 6), in welcher R<sup>4</sup> für -C(=O)C(=O)R<sup>5</sup> steht, wobei R<sup>5</sup> die oben angegebenen Bedeutungen hat.

Gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffreste wie Alkyl oder Alkenyl können, auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie z.B. in Alkoxy, soweit möglich, jeweils geradkettig oder verzweigt sein.

Gegebenenfalls substituierte Reste können einfach oder mehrfach substituiert sein, wobei bei Mehrfachsubstitutionen die Substituenten gleich oder verschieden sein können. So schließt die Definition Dialkylamino auch eine unsymmetrisch durch Alkyl substituierte Aminogruppe wie z.B. Methyl-ethylamino ein.

5

Durch Halogen substituierte Reste, wie z.B. Halogenalkyl, sind einfach oder mehrfach halogeniert. Bei mehrfacher Halogenierung können die Halogenatome gleich oder verschieden sein. Halogen steht dabei für Fluor, Chlor, Brom und Iod, insbesondere für Fluor, Chlor und Brom.

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restedefinitionen bzw. Erläuterungen können zwischen den jeweiligen Bereichen und Vorzugsbereichen beliebig kombiniert werden. Sie gelten für die Endprodukte sowie für die Vor- und Zwischenprodukte entsprechend. Insbesondere können die in den Gruppen 1 bis 6 genannten Verbindungen sowohl mit den allgemeinen wie auch mit bevorzugten, besonders bevorzugten usw. Bedeutungen kombiniert werden, wobei auch hier jeweils alle Kombinationen zwischen den Vorzugsbereichen möglich sind.

## Beschreibung der erfindungsgemäßen Verfahren zum Herstellen der Hexylcarboxanilide der Formel (I) sowie der Zwischenprodukte

#### 20 Verfahren (a)

Verwendet man 2-Trifluormethylbenzoesäurechlorid und 4-Chlor-2-(4,4,4-trifluor-3-methyl-butyl)-phenylamin als Ausgangsstoffe, so kann das erfindungsgemäße Verfahren (a) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Carbonsäure-Derivate sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel (II) hat A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für A angegeben wurden. X¹ steht bevorzugt für Chlor, Brom oder Hydroxy.

Die Carbonsäure-Derivate der Formel (II) sind größtenteils bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen (vgl. WO 93/11117, EP-A 0545 099, EP-A 0589 301 und EP-A 0589 313).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Anilin-Derivate sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel (III) haben R, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und M bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt angegeben wurden.

Die Anilin-Derivate der Formel (III) sind neu.

10

5

Anilin-Derivate der Formel (III-a)

$$\begin{array}{c|c}
 & M \\
 & M \\
 & R^{4-A} \\
 & R^{1}
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
 & R^{2} \\
 & R^{3}
\end{array}$$
(III-a)

in welcher R, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4-A</sup> und M die oben angegebenen Bedeutungen haben, werden erhalten, indem man

15 c) Anilin-Derivate der Formel (III-b)

$$H_2N$$
 $R^1$ 
 $R^2$ 
 $R^3$ 
(III-b)

in welcher R,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  und M die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit Halogeniden der Formel (IV)

$$R^{4-A} - X^2$$
 (IV)

20

in welcher  $R^{4-A}$  und  $X^2$  die oben angegebenen Bedeutungen haben, in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Anilin-Derivate der Formel (III-c)

$$H_2N$$
 $R^2$ 
 $R^3$ 
(III-c)

- in welcher R, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben, werden erhalten, indem man
  - d) Anilin-Derivate der Formel (III-d)

$$\begin{array}{c} R^{11-B} \\ R_2 \\ R^3 \end{array} \qquad \text{(IIII-d)}$$

in welcher

R, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

R<sup>11-B</sup> für Fluor oder Chlor steht,

in Gegenwart eines Reduktionsmittels, eines Katalysators und eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Anilin-Derivate der Formel (III-e)

$$H_2N$$
 $R^{11-C}$ 
 $R^2$ 
 $R^3$ 
(IIII-e)

10 in welcher

15

20

5

R, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

 $R^{11-C}$  für Fluor, Chlor, Methyl, iso-Propyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht, werden erhalten, indem man

e) Haloalkanonaniline der Formel (V)

$$H_2N \longrightarrow \mathbb{R}^{11-c}$$

$$\mathbb{R}^2 \mathbb{R}$$

$$\mathbb{R}^3$$
(V)

in welcher R, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und R<sup>11-C</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Hydrazin oder Hydrazinhydrat in Gegenwart einer Base (z.B. Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxide wie Natriumhydroxid oder Kaliumhydroxid) und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Haloalkanonaniline der Formel (V)

$$H_2N = R^{11-C}$$

$$R^2 R$$

$$R^3$$

$$(V)$$

in welcher R,  $R^2$ ,  $R^3$  und  $R^{11-C}$  die oben angegebenen Bedeutungen haben, werden erhalten, indem man

f) geschützte Haloalkanonaniline der Formel (VI)

$$SG \xrightarrow{R} R^{11-C}$$

$$R^{2} R \qquad (VI)$$

in welcher

5

10

R, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und R<sup>11-C</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

SG für eine Schutzgruppe, bevorzugt Piv (tert-Butylcarbonyl), Boc (tert-Butoxycarbonyl-), Cbz (Benzyloxycarbonyl-), Trifluoracetyl-, Fmoc (9-Fluorenylmethoxycarbonyl-) oder Troc (2,2,2-Trichlorethoxycarbonyl-), steht,

in Gegenwart einer Säure (z.B. Salzsäure) und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Geschützte Haloalkanonaniline der Formel (VI)

$$SG \xrightarrow{R} R^{11-C}$$

$$R^{2} R$$

$$R^{3}$$
(VI)

in welcher  $R, R^2, R^3, R^{11-C}$  und SG die oben angegebenen Bedeutungen haben, werden erhalten, indem man

15 g) Geschützte Aniline der Formel (VII)

in welcher R<sup>11-C</sup> und SG die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit einem Ester der Formel (VIII)

$$R^{49}O$$
  $R^2R$  (VIII)

20 in welcher

R, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

 $R^{49}$  für  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl, bevorzugt Methyl oder Ethyl, steht,

in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und metallorganischer Basen umsetzt.

25 Geschützte Aniline der Formel (VII) und Ester der Formel (VIII) sind bekannt.

Anilin-Derivate der Formel (III-f)

$$H_2N$$
 $R^{11-C}$ 
 $R^2R$ 
 $R^3$ 
(III-f)

in welcher

R, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und R<sup>11-C</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

- 5 werden erhalten, indem man
  - h) Alkene der Formel (IX)

$$H_2N$$
 $R^{2}R$ 
 $R^{3}$ 
(IX)

in welcher R, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und R<sup>11-C</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators hydriert.

Alkene der Formel (IX)

10

15

20

$$H_2N \longrightarrow \mathbb{R}^{11-C}$$

$$H_2 N \longrightarrow \mathbb{R}^2 \mathbb{R}$$

$$H_3 C \longrightarrow \mathbb{R}^3$$
(IX)

in welcher R,  $R^2$ ,  $R^3$  und  $R^{11-C}$  die oben angegebenen Bedeutungen haben, werden erhalten, indem man

i) Hydroxyalkylaniline der Formel (X)

$$H_2N$$
 $R^{11-C}$ 
 $R^2$ 
 $R^3$ 
 $R^3$ 
 $R^3$ 

in welcher R,  $R^2$ ,  $R^3$  und  $R^{11\text{-}C}$  die oben angegebenen Bedeutungen haben, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure dehydratisiert.

Hydroxyalkylaniline der Formel (X)

$$\begin{array}{c|c}
 & R^{11-c} \\
 & R^{2} \\
 & R^{3}
\end{array}$$
(X)

in welcher  $R,\,R^2,\,R^3$  und  $R^{11\text{-C}}$  die oben angegebenen Bedeutungen haben, werden erhalten, indem man

### k) Haloalkanonaniline der Formel (V)

$$H_2N$$

$$R^{11-C}$$

$$R^2R$$

$$R^3$$
(V)

in welcher R, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und R<sup>11-C</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit metallorganischen Verbindungen (z.B. Methylmagnesium Halogeniden) in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

#### 10 Anilin-Derivate der Formel (III-g)

$$H_2N$$
 $R^2$ 
 $R^3$ 
(III-g)

in welcher

5

15

 $R,\,R^1,\,R^2$  und  $R^3$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

 $M^A$  für einen jeweils einfach durch  $R^{11}$  substituierten Pyridin- oder Pyrimidin-Ring oder für einen einfach durch  $R^{11-A}$  substituierten Thiazol-Ring steht,

können analog oder nach bekannten Verfahren (vgl. EP-A 0 737 682) erhalten werden.

#### Verfahren (b)

Verwendet man 3-(Difluormethyl)-1-methyl-N-[2-(4,4,4-trifluor-3-methylbutyl)phenyl]-1H-pyrazol4-carboxamid und Ethyl-chlor(oxo)acetat als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten Hexylcarboxanilide sind durch die Formel (I-a) allgemein definiert. In dieser Formel (I-a) haben R, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, M und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

Die Hexylcarboxanilide der Formel (I-a) sind ebenfalls erfindungsgemäße Verbindungen und Gegenstand dieser Anmeldung. Sie können nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (a) erhalten werden (mit R<sup>1</sup> = Wasserstoff).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Halogenide sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel (IV) hat R<sup>4-A</sup> bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-b) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diesen Rest angegeben wurden. X<sup>2</sup> steht bevorzugt für Chlor oder Brom.

Halogenide der Formel (IV) sind bekannt.

Reaktionsbedingungen

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie z.B. Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie z.B. Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-tert-butylether, Methyl-tert-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol oder Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid.

Das erfindungsgemäße Verfahren (a) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säure-akzeptors durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie z.B. Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoni-

20

25

30

35

5

10

10

15

20

umhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumcarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylamilin, N,N-Dimethylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Das erfindungsgemäße Verfahren (a) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Kondensationsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle üblicherweise für derartige Amidierungsreaktionen verwendbaren Kondensationsmittel infrage. Beispielhaft genannt seien Säurehalogenidbildner wie Phosgen, Phosphortribromid, Phosphortrichlorid, Phosphorpentachlorid, Phosphoroxychlorid oder Thionylchlorid; Anhydridbildner wie Chlorameisensäureethylester, Chlorameisensäuremethylester, Chlorameisensäureisopropylester, Chlorameisensäureisobutylester oder Methansulfonylchlorid; Carbodiimide, wie N,N'-Dicyclohexylcarbodiimid (DCC) oder andere übliche Kondensationsmittel, wie Phosphorpentoxid, Polyphosphorsäure, N,N'-Carbonyldiimidazol, 2-Ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydrochinolin (EEDQ), Triphenylphosphin/Tetrachlorkohlenstoff oder Brom-tripyrrolidinophosphonium-hexafluorophosphat.

Das erfindungsgemäße Verfahren (a) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt. Beispielsweise genannt seien 4-Dimethylaminopyridin, 1-Hydroxy-benzotriazol oder Dimethylformamid.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis 80°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro mol des Carbonsäure-Derivates der Formel (II) im Allgemeinen 0,2 bis 5 mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 mol an Anilin-Derivat der Formel (III) ein.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (b) und (c) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie z.B. Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie z.B. Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-tert-butylether, Methyl-tert-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2- Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol oder Amide, wie

10

25

30

35

N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (b) und (c) werden in Gegenwart einer Base durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie z.B. Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Caesiumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (b) und (c) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 110°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) zur Herstellung der Verbindungen der 20 Formel (I) setzt man pro Mol des Hexylcarboxanilids der Formel (I-a) im Allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 Mol an Halogenid der Formel (IV) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (III-a) setzt man pro Mol des Anilin-Derivates der Formel (III-b) im Allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 Mol an Halogenid der Formel (IV) ein.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-tert-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2- Dimethoxyethan, 1,2- Diethoxyethan oder Anisol; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder iso-Propanol, n-, iso-, secoder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmo-

10

15

20

nomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, Triethylenglykol, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Das erfindungsgemäße Verfahren (d) wird in Gegenwart eines Metalls durchgeführt. Als solche kommen vorzugsweise Übergangsmetalle, wie beispielsweise Palladium, Platin, Rhodium, Nickel, Eisen, Cobalt, Ruthenium, Iridium oder Osmium infrage. Die Metalle können gegebenenfalls an Trägermaterialien, wie z. B. Kohle, Harze, Zeolithe, Alkali- oder Erdalkalisulfate gebunden sein.

Das erfindungsgemäße Verfahren (d) wird in Gegenwart eines Reduktionsmittels durchgeführt. Als solche kommen vorzugsweise elementarer Wasserstoff, Formiatsalze, vorzugsweise Alkaliformiatsalze, wie z. B. Natriumformiat, aber auch Ammoniumformiat oder auch Metallhydride (Hydrodehalogenierung) infrage.

Das erfindungsgemäße Verfahren (d) kann in Gegenwart von Säuren durchgeführt werden. Als solche kommen vorzugsweise organische Säuren, wie z. B. Ameisensäure, Essigsäure, Ascorbinsäure, aber auch Mineralsäuren, wie z.B. Salzsäure oder Schwefelsäure infrage.

Das erfindungsgemäße Verfahren (d) kann in Gegenwart von Basen durchgeführt werden. Als solche kommen vorzugsweise organische Basen, wie z. B. Pyridin, aber auch wässrige Lösungen von Alkalioder Erdalkalimetallhydroxiden, wie z.B. Natriumhydroxid oder Bariumhydroxid infrage.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von –80°C bis 300°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis 200°C.

Bei der Verwendung von elementarem Wasserstoff wird das erfindungsgemäße Verfahren (d) unter einem Wasserstoffdruck zwischen 0.5 and 200 bar, bevorzugt zwischen 1 und 100 bar durchgeführt.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (III-c) setzt man pro Mol des Anilin-Derivates der Formel (III-d) im Allgemeinen 0,8 bis 1000 Mol, vorzugsweise 1 bis 500 Mol an Reduktionsmittel (Ammoniumformiat, Hydrid etc.) ein.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie

25

10

15

25

30

35

beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-tert-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Ketone, wie Aceton, Butanon, Methyl-isobutylketon oder Cyclohexanon; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder iso-Propanol, n-, iso-, sec- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, Triethylenglykol, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Das erfindungsgemäße Verfahren (e) wird in Gegenwart einer Base durchgeführt. Als solche kommen vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydroxide, wie beispielsweise Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid infrage.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 100°C bis 300°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 150°C bis 250°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (III-e) setzt man pro Mol des Haloalkanonaniline der Formel (V) im allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 3 Mol an Hydrazin oder Hydrazinhydrat ein.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-tert-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2- Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Ketone, wie Aceton, Butanon, Methyl-isobutylketon oder Cyclohexanon; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder iso-Propanol, n-, iso-, sec- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylen-

glykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, Triethylenglykol, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Das erfindungsgemäße Verfahren (f) wird in Gegenwart einer Säure durchgeführt. Als solche kommen vorzugsweise Mineralsäuren, wie z. B. Salzsäure, Iod- oder Bromwasserstoffsäure, Schwefelsäure oder auch organische Säuren, z. B. Trifluoressigsäure, Trifluormethansulfonsäure infrage.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 300°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 200°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (V) setzt man pro Mol des geschützten Haloalkanonanilins der Formel (VI) im Allgemeinen 0,1 bis 10000 Mol, vorzugsweise 1 bis 2000 Mol an Säure ein.

15

20

10

5

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-te-butylether, Methyl-tert-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2- Dimethoxyethan, 1,2- Diethoxyethan oder Anisol;.

24

Das erfindungsgemäße Verfahren (g) wird in Gegenwart einer metallorganischen Verbindung durchgeführt. Als solche kommen vorzugsweise Lithiumorganische Verbindungen, wie n-, sec-, oder tert-Butyllithium, Phenyllithium oder Methyllithium infrage.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von –120°C bis 100°C, vorzugsweise bei Temperaturen von –80°C bis 20°C.

30

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (VI) setzt man pro Mol des geschützten Anilins der Formel (VII) im Allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 Mol an Ester der Formel (VIII) ein.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische oder alicycli-

10

15

sche Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan oder Decalin; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methylctert-butylether, Methylctert-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2- Dimethoxyethan oder 1,2-Diethoxyethan; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder iso-Propanol, n-, iso-, sec- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Das erfindungsgemäße Verfahren (h) wird in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt. Als solche kommen alle Katalysatoren infrage, die für Hydrierungen üblicherweise verwendet werden. Beispielhaft seien genannt: Raney-Nickel, Palladium oder Platin, gegebenenfalls auf einem Trägermaterial, wie beispielsweise Aktivkohle.

Die Hydrierung im erfindungsgemäßen Verfahren (h) kann statt in Gegenwart von Wasserstoff in Kombination mit einem Katalysator auch in Anwesenheit von Triethylsilan durchgeführt werden.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 100°C.

Das erfindungsgemäße Verfahren (h) wird unter einem Wasserstoffdruck zwischen 0.5 and 200 bar, bevorzugt zwischen 2 und 50 bar, besonders bevorzugt zwischen 3 und 10 bar durchgeführt.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (i) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-tert-butylether, Methyltert-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Ketone, wie Aceton, Butanon, Methyl-isobutylketon oder Cyclohexanon; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder iso-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder iso-Propanol, n-, iso-, sec- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

25

30

15

20

25

Das erfindungsgemäße Verfahren (i) wird gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure durchgeführt. Als solche kommen alle anorganischen und organischen Protonen- wie auch Lewissäuren, sowie auch alle polymeren Säuren infrage. Hierzu gehören beispielsweise Chlorwasserstoff, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, Trifluoressigsäure, Methansulfonsäure, Trifluormethansulfonsäure, Toluolsulfonsäure, Bortrifluorid (auch als Etherat), Bortribromid, Aluminiumtrichlorid, Titantetrachlorid, Tetrabutylorthotitanat, Zinkchlorid, Eisen-III-chlorid, Antimonpentachlorid, saure Ionenaustauscher, saure Tonerden und saures Kieselgel.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (i) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis 80°C.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (i) und (h) können auch in einer Tandemreaktion ("Eintopf-Reaktion") durchgeführt werden. Dazu wird eine Verbindung der Formel (X) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (geeignete Lösungsmittel wie für Verfahren (i)), gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure (geeignete Säuren wie für Verfahren (i)) und in Anwesenheit von Triethylsilan umgesetzt.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (k) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-tert-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol.

Das erfindungsgemäße Verfahren (k) wird in Gegenwart einer metallorganischen Verbindung durchgeführt. Als solche kommen vorzugsweise Methylmagnesium-chlorid, -bromid, oder -iodid oder Methyllithium infrage.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (k) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von –120°C bis 200°C, vorzugsweise bei Temperaturen von –80°C bis 100°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (k) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (X) setzt man pro Mol des Haloalkanonanilins der Formel (V) im Allgemeinen 0,8 bis 10 Mol, vorzugsweise 1 bis 5 Mol an metallorganischer Verbindung ein.

Wenn nicht anders angegeben, werden alle erfindungsgemäßen Verfahren im Allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck – im Allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar – zu arbeiten.

Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

Fungizide lassen sich Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.

Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise Xanthomonas campestris pv. oryzae;

Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise Pseudomonas syringae pv. lachrymans;

Erwinia-Arten, wie beispielsweise Erwinia amylovora;

20 Pythium-Arten, wie beispielsweise Pythium ultimum;

Phytophthora-Arten, wie beispielsweise Phytophthora infestans;

Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise Pseudoperonospora humuli oder

Pseudoperonospora cubensis;

Plasmopara-Arten, wie beispielsweise Plasmopara viticola;

25 Bremia-Arten, wie beispielsweise Bremia lactucae;

Peronospora-Arten, wie beispielsweise Peronospora pisi oder P. brassicae;

Erysiphe-Arten, wie beispielsweise Erysiphe graminis;

Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise Sphaerotheca fuliginea;

Podosphaera-Arten, wie beispielsweise Podosphaera leucotricha;

30 Venturia-Arten, wie beispielsweise Venturia inaequalis:

Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise Pyrenophora teres oder P. graminea

(Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise Cochliobolus sativus

(Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

35 Uromyces-Arten, wie beispielsweise Uromyces appendiculatus;

Puccinia-Arten, wie beispielsweise Puccinia recondita;

20

25

Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise Sclerotinia sclerotiorum;

Tilletia-Arten, wie beispielsweise Tilletia caries;

Ustilago-Arten, wie beispielsweise Ustilago nuda oder Ustilago avenae;

Pellicularia-Arten, wie beispielsweise Pellicularia sasakii;

5 Pyricularia-Arten, wie beispielsweise Pyricularia oryzae;

Fusarium-Arten, wie beispielsweise Fusarium culmorum;

Botrytis-Arten, wie beispielsweise Botrytis cinerea;

Septoria-Arten, wie beispielsweise Septoria nodorum:

Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise Leptosphaeria nodorum;

10 Cercospora-Arten, wie beispielsweise Cercospora canescens;

Alternaria-Arten, wie beispielsweise Alternaria brassicae;

Pseudocercosporella-Arten, wie beispielsweise Pseudocercosporella herpotrichoides.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine starke stärkende Wirkung in Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeneigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen.

Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem von Pflanzen so zu stimulieren, dass die behandelten Pflanzen bei nachfolgender Inokulation mit unerwünschten Mikroorganismen weitgehende Resistenz gegen diese Mikroorganismen entfalten.

Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den Befall durch die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeitraum, innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanzund Saatgut, und des Bodens.

Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Getreidekrankheiten, wie beispielsweise gegen Puccinia-Arten und von Krankheiten im Wein-, Obstund Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen Botrytis-, Venturia- oder Alternaria-Arten, einsetzen.

10

15

20

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen und Aufwandmengen auch als Herbizide, zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums, sowie zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- und Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaren oder nicht schützbaren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stängel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien

25

30

10

20

25

30

35

auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, holzverfärbende und holzzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.

Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:

Alternaria, wie Alternaria tenuis,

15 Aspergillus, wie Aspergillus niger,
Chaetomium, wie Chaetomium globosum,
Coniophora, wie Coniophora puetana,
Lentinus, wie Lentinus tigrinus,
Penicillium, wie Penicillium glaucum,

Polyporus, wie Polyporus versicolor,
Aureobasidium, wie Aureobasidium pullulans,
Sclerophoma, wie Sclerophoma pityophila,
Trichoderma, wie Trichoderma viride,
Escherichia, wie Escherichia coli,
Pseudomonas, wie Pseudomonas aeruginosa,

Staphylococcus, wie Staphylococcus aureus.

Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/ oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Be-

10

15

20

nutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im Wesentlichen infrage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorebenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen infrage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum. Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen infrage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Bims, Marmor, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstängel. Als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen infrage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylarylpolyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen infrage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen

25

30

vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen infrage:

### 5 Fungizide:

10

15

20

25

30

35

2-Phenylphenol; 8-Hydroxychinolinsulfat; Acibenzolar-S-methyl; Aldimorph; Amidoflumet; Ampropylfos; Ampropylfos-potassium; Andoprim; Anilazine; Azaconazole; Azoxystrobin; Benalaxyl; Benodanil; Benomyl; Benthiavalicarb-isopropyl; Benzamacril; Benzamacril-isobutyl; Bilanafos; Binapacryl; Biphenyl; Bitertanol; Blasticidin-S; Bromuconazole; Bupirimate; Buthiobate; Butylamin; Calcium polysulfide; Capsimycin; Captafol; Captan; Carbendazim; Carboxin; Carpropamid; Carvone; Chinomethionat; Chlobenthiazone; Chlorfenazole; Chloroneb; Chlorothalonil; Chlozolinate; Clozylacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; Cymoxanil; Cyproconazole; Cyprodinil; Cyprofuram; Dagger G; Debacarb; Dichlofluanid; Dichlone; Dichlorophen; Diclocymet; Diclomezine; Dicloran; Diethofencarb; Difenoconazole; Diflumetorim; Dimethirimol; Dimethomorph; Dimoxystrobin; Diniconazole; Diniconazole-M; Dinocap; Diphenylamine; Dipyrithione; Ditalimfos; Dithianon; Dodine; Drazoxolon; Edifenphos; Epoxiconazole; Ethaboxam; Ethirimol; Etridiazole; Famoxadone; Fenamidone; Fenapanil; Fenarimol; Fenbuconazole; Fenfuram; Fenhexamid; Fenitropan; Fenoxanil; Fenpiclonil; Fenpropidin; Fenpropimorph; Ferbam; Fluazinam; Flubenzimine; Fludioxonil; Flumetover; Flumorph; Fluoromide; Fluoxastrobin; Fluquinconazole; Flurprimidol; Flusilazole; Flusulfamide; Flutolanil; Flutriafol; Folpet; Fosetyl-Al; Fosetyl-sodium; Fuberidazole; Furalaxyl; Furametpyr; Furcarbanil; Furmecyclox; Guazatine; Hexachlorobenzene; Hexaconazole; Hymexazol; Imazalil; Imibenconazole; Iminoctadine triacetate; Iminoctadine tris(albesil; Iodocarb; Ipconazole; Iprobenfos; Iprodione; Iprovalicarb; Irumamycin; Isoprothiolane; Isovaledione; Kasugamycin; Kresoxim-methyl; Mancozeb; Maneb; Meferimzone; Mepanipyrim; Mepronil; Metalaxyl; Metalaxyl-M; Metconazole; Methasulfocarb; Methfuroxam; Metiram; Metominostrobin; Metsulfovax; Mildiomycin; Myclobutanil; Myclozolin; Natamycin; Nicobifen; Nitrothal-isopropyl; Noviflumuron; Nuarimol; Ofurace; Orysastrobin; Oxadixyl; Oxolinic acid; Oxpoconazole; Oxycarboxin; Oxyfenthiin; Paclobutrazol; Pefurazoate; Penconazole; Pencycuron; Phosdiphen; Phthalide; Picoxystrobin; Piperalin; Polyoxins; Polyoxorim; Probenazole; Prochloraz; Procymidone; Propamocarb; Propanosine-sodium; Propiconazole; Propineb; Proquinazid; Prothioconazole; Pyraclostrobin; Pyrazophos; Pyrifenox; Pyrimethanil; Pyroquilon; Pyroxyfur; Pyrrolnitrine; Quinconazole; Quinoxyfen; Quintozene; Simeconazole; Spiroxamine; Sulfur; Tebuconazole; Tecloftalam; Tecnazene; Tetcyclacis; Tetraconazole; Thiabendazole; Thicyofen; Thifluzamide; Thiophanate-methyl; Thiram; Tioxymid; Tolclofos-methyl; Tolylfluanid; Triadimefon; Triadimenol; Triazbutil; Triazoxide; Tricyclamide; Tricyclazole; Tridemorph; Trifloxystrobin; Triflumizole; Triforine; Triticonazole; Uniconazole; Validamycin A; Vinclozolin; Zineb; Ziram; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-Chlorphenyl)-2-propinyl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-Zoxamide:

[(methylsulfonyl)amino]-butanamid; 1-(1-Naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion; 2,3,5,6-Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)-pyridin; 2-Amino-4-methyl-N-phenyl-5-thiazolcarboxamid; 2-Chlor-N-(2,3-di-hydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamide; 3,4,5-Trichlor-2,6-pyridindicarbonitril; Actinovate; cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol; Methyl 1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat; Monokaliumcarbonat; N-(6-Methoxy-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid; N-Butyl-8-(1,1-dimethylethyl)-1-oxaspiro[4.5]decan-3-amin; Natriumtetrathiocarbonat; sowie Kupfersalze und -zubereitungen, wie Bordeaux mixture; Kupferhydroxid; Kupfernaphthenat; Kupferoxychlorid; Kupfersulfat; Cufraneb; Kupferoxid; Mancopper; Oxine-copper.

10

5

#### Bakterizide:

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Octhilinon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

15

20

25

30

35

#### Insektizide / Akarizide / Nematizide:

Abamectin, ABG-9008, Acephate, Acequinocyl, Acetamiprid, Acetoprole, Acrinathrin, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Allethrin, Allethrin 1R-isomers, Alpha-Cypermethrin (Alphamethrin), Amidoflumet, Aminocarb, Amitraz, Avermectin, AZ-60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos-methyl, Azinphos-ethyl, Azocyclotin, Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Bacillus thuringiensis strain EG-2348, Bacillus thuringiensis strain GC-91, Bacillus thuringiensis strain NCTC-11821, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Beta-Cyfluthrin, Beta-Cypermethrin, Bifenazate, Bifenthrin, Binapacryl, Bioallethrin, Bioallethrin-S-cyclopentyl-isomer, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bioresmethrin, Bistrifluron, BPMC, Brofenprox, Bromophosethyl, Bromopropylate, Bromfenvinfos (-methyl), BTG-504, BTG-505, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butoxycarboxim, Butylpyridaben, Cadusafos, Camphechlor, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, CGA-50439, Chinomethionat, Chlordane, Chlordimeform, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorobenzilate, Chloropicrin, Chlorproxyfen, Chlorpyrifos-methyl, Chlorpyrifos (-ethyl), Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Cypermethrin, Cis-Resmethrin, Cis-Permethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidin, Clothiazoben, Codlemone, Coumaphos, Cyanofenphos, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cydia pomonella, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyphenothrin (1R-trans-isomer), Cyromazine, DDT, Deltamethrin, Demeton-S-methyl, Demeton-Smethylsulphon, Diafenthiuron, Dialifos, Diazinon, Dichlofenthion, Dichlorvos, Dicofol, Dicrotophos, Dicyclanil, Diflubenzuron, Dimethoate, Dimethylvinphos, Dinobuton, Dinocap, Dinotefuran, Dio-

10

15

20

25

30

35

fenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn, DOWCO-439, Eflusilanate, Emamectin, Emamectin-benzoate, Empenthrin (1R-isomer), Endosulfan, Entomopthora spp., EPN, Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethiprole, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos, Famphur, Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenfluthrin, Fenitrothion, Fenobucarb, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fensulfothion, Fenthion, Fentrifanil, Fenvalerate, Fipronil, Flonicamid, Fluacrypyrim, Fluazuron, Flubenzimine, Flubrocythrinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenerim, Flufenoxuron, Flufenprox, Flumethrin, Flupyrazofos, Flutenzin (Flufenzine), Fluvalinate, Fonofos, Formetanate, Formothion, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox (Fluproxyfen), Furathiocarb, Gamma-HCH, Gossyplure, Grandlure, Granuloseviren, Halfenprox, Halofenozide, HCH, HCN-801, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydramethylnone, Hydroprene, IKA-2002, Imidacloprid, Imiprothrin, Indoxacarb, Iodofenphos, Iprobenfos, Isazofos, Isofenphos, Isoprocarb, Isoxathion, Ivermectin, Japonilure, Kadethrin, Kernpolyederviren, Kinoprene, Lambda-Cyhalothrin, Lindane, Lufenuron, Malathion, Mesulfenfos, Metaldehyd, Metam-sodium, Methacrifos, Methamidophos, Methamizium anisopliae. Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Methoprene, Methoxychlor, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin, MKI-245, MON-45700, Monocrotophos, Moxidectin, MTI-800, Naled, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, Niclosamide, Nicotine, Nitenpyram, Nithiazine, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768, Novaluron, Noviflumuron, OK-5101, OK-5201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, Omethoate, Oxamyl, Oxydemeton-methyl, Paecilomyces fumosoroseus, Parathion-methyl, Parathion (-ethyl), Permethrin (cis-, trans-), Petroleum, PH-6045, Phenothrin (1R-trans isomer), Phenthoate, Phorate, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phosphocarb, Phoxim, Piperonyl butoxide, Pirimicarb, Pirimiphos-methyl, Pirimiphos-ethyl, Prallethrin, Profenofos, Promecarb, Propaphos, Propargite, Propetamphos, Propoxur, Prothiofos, Prothoate, Protrifenbute, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridalyl, Pyridaphenthion, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen, Quinalphos, Resmethrin, RH-5849, Ribavirin, RU-12457, RU-15525, S-421, S-1833, Salithion, Sebufos, SI-0009, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Spiromesifen, Sulfluramid, Sulfotep, Sulprofos, SZI-121, Tau-Fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimfos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temivinphos, Terbam, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Tetramethrin, Tetramethrin (1R-isomer), Tetrasul, Theta-Cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil. Thiatriphos, Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thiometon, Thiosultap-sodium, Thuringiensin, Tolfenpyrad, Tralocythrin, Tralomethrin, Transfluthrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb, Vamidothion, Vaniliprole, Verbutin, Verticillium lecanii, WL-108477, WL-40027, YI-5201, YI-5301, YI-5302, XMC, Xylylcarb, ZA-3274, Zeta-Cypermethrin, Zolaprofos, ZXI-8901, die Verbindung 3-Methylphenyl-propylcarbamat (Tsumacide Z), die Verbindung 3-(5-Chlor-3-pyridinyl)-8-(2,2,2-trifluor-

15

20

ethyl)-8-azabicyclo[3.2.1]octan-3-carbonitril (CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3) und das entsprechende 3-endo-Isomere (CAS-Reg.-Nr. 185984-60-5) (vgl. WO-96/37494, WO-98/25923), sowie Präparate, welche insektizid wirksame Pflanzenextrakte, Nematoden, Pilze oder Viren enthalten.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren, Safener bzw. Semiochemicals ist möglich.

Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sprosspilze, Schimmel und diphasische Pilze (z.B. gegen Candida-Spezies wie Candida albicans, Candida glabrata) sowie Epidermophyton floccosum, Aspergillus-Spezies wie Aspergillus niger und Aspergillus fumigatus, Trichophyton-Spezies wie Trichophyton mentagrophytes, Microsporon-Spezies wie Microsporon canis und audouinii. Die Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren mykotischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwandmengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden.

In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und

10

15

20

25

30

35

Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetically Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff "Teile" bzw. "Teile von Pflanzen" oder "Pflanzenteile" wurde oben erläutert.

Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften ("Traits"), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Rassen, Bio- und Genotypen sein.

Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive ("synergistische") Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften ("Traits") verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleumigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak, Raps sowie Obstpflanzen (mit

10

15

20

25

30

den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften ("Traits") werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten, Spinnentiere, Nematoden und Schnecken durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus Bacillus Thuringiensis (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im Folgenden "Bt Pflanzen"). Als Eigenschaften ("Traits") werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften ("Traits") werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, z.B. Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften ("Traits") verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für "Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucoton® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften ("Traits").

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den folgenden Beispielen hervor.

### Herstellungsbeispiele

#### Beispiel 1

- Zu einer Lösung bestehend aus 275.3 mg (1.3 mmol) 2-Trifluormethylbenzoesäurechlorid und 0.22 ml (1.6 mmol) Triethylamin in 10 ml Tetrahydrofuran werden 302.0 mg (1.2 mmol) 4-Chlor-2-(4,4,4-trifluor-3-methyl-butyl)-phenylamin in 2 ml Tetrahydrofuran gegeben. Die Reaktionslösung wird für 90 min bei 60°C gerührt, über Kieselgel filtriert und im Vakuum aufkonzentriert.
- Man erhält 505 mg (99 % der Theorie) an N-[4-Chloro-2-(4,4,4-trifluoro-3-methyl-butyl)-phenyl]-2-trifluoromethyl-benzamid [logP (pH 2.3) = 4.08].

### Beispiel 2

- Zu einer Suspension von 264.2 mg (1.5 mmol) 3-Difluormethyl-1-methyl-1H-pyrazol-4-carbonsäure in 9 ml Dichlormethan werden 0.14 ml (1.7 mmol) Oxalsäuredichlorid und 4 Tropfen Dimethylformamid gegeben. Die Reaktionsmischung wird 2 h bei Raumtemperatur gerührt und anschließend mit einer Lösung bestehend aus 325.9 mg (1.5 mmol) 2-(4,4,4-Trifluor-3-methyl-butyl)-phenylamin und 0.29 ml (2.1 mmol) Triethylamin in 9 ml Dichlormethan versetzt. Die Reaktionsmischung wird 16 h bei Raumtemperatur gerührt. Zur Aufarbeitung werden 7 ml 2N Salzsäure zugegeben, 10 min bei Raumtemperatur gerührt, die organische Phase abgetrennt, über Magnesiumsulfat getrocknet, filtriert und im Vakuum aufkonzentriert.
- Man erhält 525.0 mg (89 % der Theorie) an 3-Difluormethyl-1-methyl-1H-pyrazol-4-carbonsäure-[2- (4,4,4-trifluor-3-methyl-butyl)-phenyl]-amid [logP (pH 2.3) = 2.93].
  - Analog Beispiel 1 und 2, sowie entsprechend den Angaben in der allgemeinen Beschreibung der erfindungsgemäßen Herstellverfahren (a) bis (h) wurden auch die in der nachstehenden Tabelle 1 genannten Verbindungen der Formel (I) erhalten:

# Tabelle 1

$$A \xrightarrow{N} M \\ R^4 \\ R^1 \\ H \\ R^3$$
 (I)

Nr.	R	$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	$\mathbb{R}^3$	$\mathbb{R}^4$	M	A	logP
3	Н	СН₃	C₂H₅	Cl	Н	***************************************	F <sub>2</sub> HC N N I CH <sub>3</sub>	3,18
4	Н	СН₃	C₂H₅	Cl	н	****	H <sub>3</sub> C N N N CH <sub>3</sub>	3,09
5	Н	Н	СН₃	CF <sub>3</sub>	Н	* # CI		4,08
6	н	Н	CH₃	CF <sub>3</sub>	Н	* CI	H <sub>3</sub> C N N N F CH <sub>3</sub>	3,32
7	- <b>H</b>	Н	СН₃	CF <sub>3</sub>	Н	* CI	F <sub>2</sub> HC N N CH <sub>3</sub>	3,36
8	Н	Н	СН₃	CF <sub>3</sub>	Н	* CI	CH <sub>3</sub>	3,99
9	Н	H	СН₃	CF <sub>3</sub>	Н	* #	CF <sub>3</sub>	3,66
10	Н	Н	СН₃	CF <sub>3</sub>	Н	***************************************	H <sub>3</sub> C N N N CH <sub>3</sub>	2,84

<sup>&</sup>lt;sup>a</sup>) Die mit "\*" markierte Bindung ist mit dem Amid, die mit "#" markierte Bindung mit dem Haloalkylrest verknüpft.

# Herstellung der Ausgangsstoffe der Formel (III)

### Beispiel (III-1)

Eine Lösung von 7.0 g 1-(2-Amino-5-chlor-phenyl)-4,4,4-trifluor-3-methyl-butan-1-on (26 mmol), 4.0 g Kaliumhydroxid (60 mmol) und 3.0 g Hydrazinhydrat (60 mmol) wird in 67 ml Triethylenglykol für 6 h auf 210°C erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur werden Wasser und Ethylacetat zugegeben, die Phasen getrennt und die organische Phase nochmals mit Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und vom Lösungsmittel befreit.

Man erhält 4.9 g (73 % der Theorie) an 4-Chlor-2-(4,4,4-trifluor-3-methyl-butyl)-phenylamin.

<sup>1</sup>H-NMR (DMSO):  $\delta$  = 6.93 (m, 2 H), 6.62 (d, 1 H), 5.05 (s, 2 H), 2.56 (m, 1 H), 2.48-2.34 (m, 2 H), 1.85 (m, 1 H), 1.47 (m, 1 H), 1.11 (d, 3 H).

### Beispiel (III-2)

10

15

20

Eine Lösung von 2.3 g 4-Chlor-2-(4,4,4-trifluor-3-methyl-butyl)-phenylamin (III-1) (9 mmol), 1.15 g Ammoniumformiat (18 mmol) und 2.0 g Pd/C (5%ig, 0.9 mmol) in 21 ml Methanol wird 1 h bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wird die Reaktionslösung über Celite abgesaugt, mit Methanol nachgewaschen und das Filtrat einrotiert. Verrühren des Rückstandes nach Entfernen des Lösungsmittels mit Pentan liefert einen Feststoff, der abgesaugt und getrocknet wird.

Man erhält 1.7 g (86 % der Theorie) an 2-(4,4,4-Trifluor-3-methyl-butyl)-phenylamin.

<sup>1</sup>H-NMR (DMSO):  $\delta$  = 6.89 (m, 2 H), 6.61 (m, 1 H), 6.49 (m, 1 H), 4.83 (s, 2 H), 2.57 (m, 1 H), 2.48-2.30 (m, 2 H), 1.85 (m, 1 H), 1.46 (m, 1 H), 1.13 (d, 3 H).

### Herstellung von Ausgangsstoffen der Formel (V)

#### Beispiel (V-1)

Eine Lösung von 10.0 g (29 mmol) N-[4-Chlor-2-(4,4,4-trifluor-3-methyl-butyryl)-phenyl]-2,2-dimethyl-propionamid in 366 ml 37%iger Salzsäure wird 2 Tage unter Rückfluss erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur wird mit 45%iger Natriumhydroxid-Lösung neutralisiert und die Wasserphase mit Dichlormethan extrahiert. Trocknen der organischen Phase über Natriumsulfat und Entfernen des Lösungsmittels liefert 7.1 g (93 % der Theorie) an 1-(2-Amino-5-chlor-phenyl)-4,4,4-trifluor-3-methyl-butan-1-on.

<sup>1</sup>H-NMR (DMSO):  $\delta = 7.80$  (d, 1 H), 7.34 (s, 2 H), 7.29 (dd, 1 H), 6.82 (dd, 1 H), 3.28 (dd, 1 H), 3.14 (dd, 1 H) 3.00 (m, 1 H), 1.08 (d, 3 H).

# 15 Herstellung von Ausgangsstoffen der Formel (VI)

# Beispiel (VI-1)

20

25

Eine Lösung von 15.4 g N-(4-Chlorphenyl)-2,2-dimethyl-propionamid (73 mmol) in 100 ml trockenem Tetrahydrofuran wird bei 0°C tropfenweise mit einer Lösung von n-Butyllithium in Hexan (1.6 M, 100 ml, 160 mmol) versetzt und 2 h bei dieser Temperatur gerührt. Anschließend wird diese Lösung bei –70°C zu einer Lösung von 13.4 g Ethyl-(3-trifluormethyl)-butyrat (73 mmol) in 250 ml trockenem Tetrahydrofuran zugetropft und die Reaktionsmischung 1 h bei dieser Temperatur nachgerührt. Nach Erwärmen auf Raumtemperatur wird für 16 h nachgerührt. Hydrolyse mit 100 ml Wasser, Einengen, Aufnehmen des Rückstandes in Dichlormethan/Wasser sowie Extrahieren der Wasserphase mit Dichlormethan liefert nach Trocknen der organischen Phase über Natriumsulfat ein Edukt/Produkt-Gemisch, welches durch Säulenchromatographie an Kieselgel mit Cyclohexan/Essigsäureethylester (9:1) als Laufmittel aufgetrennt werden kann.

Man erhält 10.3 g (40 % der Theorie) an N-[4-Chlor-2-(4,4,4-trifluor-3-methyl-butyryl)-phenyl]-2,2-dimethyl-propionamid.

<sup>1</sup>H-NMR (DMSO):  $\delta$  = 11.15 (s, 1 H), 8.39 (d, 1 H), 8.11 (d, 1 H), 7.67 (dd, 1 H), 3.47 (dd, 1 H), 3.30 (dd, 1 H) 2.99 (m, 1 H), 1.25 (s, 9 H), 1.15 (d, 3 H).

Die Bestimmung der angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich (pH 2,3): 0,1 % wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril.

Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren LogP-Werte bekannt sind (Bestimmung der LogP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).

Die lambda-max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima 20 der chromatographischen Signale ermittelt.

### Anwendungsbeispiele

#### Beispiel A

### Sphaerotheca-Test (Gurke) / protektiv

5 Lösungsmittel:

24,5 Gewichtsteile Aceton

24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid

Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff
mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser
auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension von Sphaerotheca fuliginea inokuliert. Die Pflanzen werden dann bei ca. 23°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 70 % im Gewächshaus aufgestellt.

7 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

# 20 <u>Tabelle A</u>

15

# Sphaerotheca-Test (Gurke) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
H <sub>3</sub> C CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> C CH <sub>3</sub>	100	95
F O CH <sub>3</sub> H <sub>3</sub> C CI	100	100

# Beispiel B

### Venturia - Test (Apfel) / protektiv

Lösungsmittel:

24,5 Gewichtsteile Aceton

24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid

5 Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Konidiensuspension des Apfelschorferregers Venturia inaequalis inokuliert und verbleiben dann 1 Tag bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 21°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca.

15 90 % aufgestellt.

10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

# 20 Tabelle B

### Venturia-Test (Apfel) / protektiv

\		
Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
F O N CH <sub>3</sub> F F F	100	93
H <sub>3</sub> C CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> C CH <sub>3</sub>	100	100
F O CH <sub>3</sub> H <sub>3</sub> C CI	100	100

### Beispiel C

### Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

Lösungsmittel:

24,5 Gewichtsteile Aceton

24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid

5 Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden auf jedes Blatt 2 kleine mit Botrytis einerea bewachsene Agarstücken aufgelegt. Die inokulierten Pflanzen werden in einer abgedunkelten Kammer bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt.

2 Tage nach der Inokulation wird die Größe der Befallsflecken auf den Blättern ausgewertet. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

<u>Tabelle C</u> **Botrytis - Test (Bohne) / protektiv** 

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
H <sub>3</sub> C O CH <sub>3</sub> H <sub>3</sub> C CH <sub>3</sub>	500	82
F O CH <sub>3</sub> H <sub>3</sub> C CI	500	100

# Beispiel D

### Puccinia-Test (Weizen) / protektiv

Lösungsmittel:

50 Gewichtsteile N,N-Dimethylacetamid

Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

5

10

15

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer Konidiensuspension von Puccinia recondita besprüht. Die Pflanzen verbleiben 48 Stunden bei 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

Die Pflanzen werden dann in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von ca. 20°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von 80 % aufgestellt, um die Entwicklung von Rostpusteln zu begünstigen.

10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

#### Tabelle D

#### Puccinia-Test (Weizen) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge	Wirkungsgrad
Erfindungsgemäß	an Wirkstoff in g/ha	in %
F O CH <sub>3</sub> H <sub>3</sub> C CI	500	100

### Beispiel E

### Alternaria-Test (Tomate) / protektiv

Lösungsmittel:

49 Gewichtsteile N, N-Dimethylformamid

Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

5

10

15

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Tomatenpflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. 1 Tag nach der Behandlung werden die Pflanzen mit einer Sporensuspension von Alternaria solani inokuliert und stehen dann 24 h bei 100 % rel. Feuchte und 20°C. Anschließend stehen die Pflanzen bei 96 % rel. Luftfeuchtigkeit und einer Temperatur von 20°C.

7 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

<u>Tabelle E</u>

Alternaria-Test (Tomate) / protektiv

Theorem 1 est (1 omate), protectiv		
Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
H <sub>3</sub> C O N CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> F	750	90
H <sub>3</sub> C CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> C CI	750	100
F CH <sub>3</sub> CI	750	95

### Patentansprüche

# 1. Haloalkylcarboxamide der Formel (I)

$$A \xrightarrow{N} M \qquad R^{2} R \qquad (I)$$

5 in welcher

R für Wasserstoff oder Halogen steht,

R<sup>1</sup> für Wasserstoff oder Methyl steht,

R<sup>2</sup> für Methyl, Ethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

R<sup>3</sup> für Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alk-oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, Halogen-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, Halogen-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkoxy)carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl)carbonyl; (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl)carbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)carbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R<sup>5</sup>, -CONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> oder -CH<sub>2</sub>NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup> steht,

R<sup>5</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl; C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C<sub>1</sub>-

 $^{10}$ 

15

20

25

C<sub>4</sub>-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR<sup>10</sup> enthalten kann,

R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl; C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR<sup>10</sup> enthalten kann,

R<sup>10</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl steht,

M für einen jeweils einfach durch R<sup>11</sup> substituierten Phenyl-, Pyridin- oder Pyrimidin-,
Pyridazin oder Pyrazin-Ring oder für einen durch R<sup>11-A</sup> substituierten Thiazol-Ring
steht.

R<sup>11</sup> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, iso-Propyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,

R<sup>11-A</sup> für Wasserstoff, Methyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,

A für den Rest der Formel (A1)

(A1) steht, in welcher

R<sup>12</sup> für Wasserstoff, Cyano, Halogen, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, Aminocarbonyl oder Aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl steht,

R<sup>13</sup> für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio steht,

R<sup>14</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Hydroxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, oder Phenyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A2)

20

5

10

15

25

R<sup>15</sup> und R<sup>16</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R<sup>17</sup> für Halogen, Cyano oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

5

10

15

20

25

A für den Rest der Formel (A3)

 $R^{18}$  und  $R^{19}$  unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

 $R^{20}$  für Wasserstoff, Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A4)

R<sup>21</sup> für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A5)

$$\mathbb{R}^{23}$$
  $\mathbb{N}$   $\mathbb{R}^{22}$  (A5) steht, in welcher

R<sup>22</sup> für Halogen, Hydroxy, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R<sup>23</sup> für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulphinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulphonyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A6)

$$R^{25}$$
  $Q^1$   $Q^2$   $Q^2$ 

(A6) steht, in welcher

R<sup>24</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

 $R^{25}$  für  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl steht,

Q<sup>1</sup> für S (Schwefel), O (Sauerstoff) SO, SO<sub>2</sub> oder CH<sub>2</sub> steht,

p für 0, 1 oder 2, wobei R<sup>25</sup> für identische oder verschiedene Reste steht, wenn p für 2 steht,

oder

5

A für den Rest der Formel (A7)

(A7) steht, in welcher

R<sup>26</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A8)

(A8) steht, in welcher

R<sup>27</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

15

20

25

A für den Rest der Formel (A9)

(A9) steht, in welcher

R<sup>28</sup> und R<sup>29</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen,

 $R^{30}$  für Wasserstoff, Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A10)

(A10) steht, in welcher

 $R^{31}$  und  $R^{32}$  unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, Nitro,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl having 1 bis 5 Halogenatomen stehen,

 $R^{33}$  für Wasserstoff, Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A11)

(A11) steht, in welcher

.

R<sup>34</sup> für Wasserstoff, Halogen, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-amino, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

 $R^{35}$  für Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogen-

atomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A12)

(A12) steht, in welcher

15

5

10

R<sup>36</sup> für Wasserstoff, Halogen, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-amino, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R<sup>37</sup> für Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder A

20

für den Rest der Formel (A13)

(A13) steht, in welcher

 $R^{38}$  für Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

25

A für den Rest der Formel (A14)

(A14) steht, in welcher

R<sup>39</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht,

 $R^{40}$  für Halogen oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A15)

(A15) steht, in welcher

R<sup>41</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A16)

$$\mathbb{R}^{N}$$

(A16) steht, in welcher

R<sup>42</sup> für Wasserstoff, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A17)

(A17) steht, in welcher

 $R^{43}$  für Halogen, Hydroxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A18)

(A18) steht, in welcher

für Wasserstoff, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Hydroxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)aminosulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenylsulfonyl oder Benzoyl steht,

R<sup>45</sup> für Wasserstoff, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

 $R^{46}$  für Wasserstoff, Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R<sup>47</sup> für Wasserstoff, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

15

5

20

oder

A für den Rest der Formel (A19)

(A19) steht, in welcher

 $R^{48}$  für  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl steht.

5

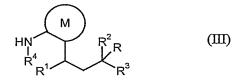
- Verfahren zum Herstellen der Haloalkylcarboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man
  - a) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)

$$A \xrightarrow{X_1} (II)$$

in welcher

A die oben angegebenen Bedeutungen hat und

X<sup>1</sup> für Halogen oder Hydroxy steht, mit Anilin-Derivaten der Formel (III)



15

in welcher R, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und M die oben angegebenen Bedeutungen haben, gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

20

b) Hexylcarboxanilide der Formel (I-a)

in welcher R, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, M und A die oben angegebenen Bedeutungen haben mit Halogeniden der Formel (IV)

$$R^{4-A} X^2$$
 (IV)

25

in welcher

X<sup>2</sup> für Chlor, Brom oder Iod steht,

R<sup>4-A</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio,

 $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- $C_1$ - $C_4$ -alkoxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl,  $C_3$ - $C_8$ -Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl,  $(C_1$ - $C_3$ -Alkoxy)-carbonyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl,  $(C_1$ - $C_3$ -Alkoxy)-carbonyl- $C_1$ - $C_3$ -alkyl, Halogen- $(C_1$ - $C_3$ -alkyl) mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

 $(C_1-C_8-Alkyl) carbonyl, \quad (C_1-C_8-Alkoxy) carbonyl, \quad (C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl) carbonyl, \quad (C_3-C_8-Cycloalkyl) carbonyl; \quad (C_1-C_6-Halogenalkyl) carbonyl, \quad (C_1-C_6-Halogenalkoxy) carbonyl, \quad (Halogen-C_1-C_4-alkoxy-C_1-C_4-alkyl) carbonyl, \quad (C_3-C_8-Halogencycloalkyl) carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlorund/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R^5, -CONR^6R^7 oder -CH_2NR^8R^9 steht,$ 

wobei R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben, in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

3. Mittel zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Haloalkylcarboxamid der Formel (I) gemäß Anspruch 1 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.

20 4. Verwendung von Haloalkylcarboxamiden der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen.

5. Verfahren zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Haloalkylcarboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die Mikroorganismen und/oder deren Lebensraum ausbringt.

6. Verfahren zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Haloalkylcarboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.

7. Anilin-Derivaten der Formel (III)

$$\begin{array}{c|c}
 & M \\
 & R^2 \\
 & R^3
\end{array}$$
(III)

in welcher R, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und M die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

15

5

10

25

# Haloalkylcarboxamide

# Zusammenfassung

Neue Haloalkylcarboxamide der Formel (I)

$$A \xrightarrow{N} \stackrel{M}{\underset{R^4}{\bigvee}} \stackrel{M}{\underset{R^2}{\bigvee}} \stackrel{R^2}{\underset{R^3}{\bigvee}}$$
 (I)

in welcher

 $R, R^1, R^2, R^3, R^4, M$  und A die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben,

mehrere Verfahren zur Herstellung dieser Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, sowie neue Zwischenprodukte und deren Herstellung.